Best Available Copy

61-77025

May 11. 1906 TREATMENT OF SUBSTANCE

INVENTOR HIDEH SATO, It will the

ACSTANCE: LIGHTCOPP APPL NOT S9 PETS52 DATE FILED. At. 18. 1984

PATER ARCHARTS OF JAPAN ARU GRE NO: 0173 APS VOL NO: Vol. 10, No. 276

ASS PUB DATE: Dap. 10, 1986

#00 T*00

ABSTRACT.

PURPOSE. To make the difficult-to-dissolve-in-water substance such as the medicines, soluble and to blend them stably by using cyclodextrin (a) your 20 DEC 94 13:17.44 U.S. Patent & Trademark Office 1991 30

61-97025

May 15, 1986

L43: 4 of 5

TREATMENT OF SUBSTANCE

having igtored.20g/100ml-water solubility for water of 25.degree.C to treat the substance.

CONSTITUTION. Cyclodextrin polymer having .gtoreq.20g/100ml-water colubility for water of 25.degree.C is added to the difficult-to-discolve-inwater substance and blanded with each other to stabilize it. As the cyclodextrin polymer, the following compd. shown by a formula f (in the formula (n) is an integer of 3.approx.4) is suitable which is obtained by subjecting cyclodextrin to crosslinking polymerization with epichlorohydein. This method can be applied to difficult-to-dissolve in-wat substances by which inclusion compds, are formed with cyclodextrin polyme but the utilization for various kinds of medicines, perfumes and dyestuf is especially effective.

20 000 94 13:17:48

U.S. Patent & Trudemark Office

19日本国特許庁(JP)

10 特許出願公開

砂公開特許公報(A)

昭61-97025

⑤Int Cl.⁴

数别記号

厅内整理番号

母公開 昭和61年(1986)5月15日

B 01 F 1/00

Z-6639-4G

審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

9発明の名称 物質の処理方法

②特 類 昭59-217332

母出 顋 昭59(1984)10月18日

砂発 明 者 佐 藤 秀 次 千葉市黒砂台3-9-37

⑫発 明 者 柳 橋 憲 夫 東京都杉並区上井草1-26-12

砂発 明 者 岩 崎 節 夫 越谷市上間久里321-9·

母 明 者 田 中 成 子 横浜市中区間門町2丁目337

①出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号

20代 理 人 弁理士 高木 正行 外1名

明 超 書

- 1. 発明の名称 物質の処理方法
- 2. 特許請求の範囲
- (i) シクロデキストリンポリマーを使用することを特徴とする物質の処理方法。
- (2) 前記シクロデキストリンポリマーとして、 2.5 での水に対する溶解度が2.0 g/100 = (水) 以上のものを使用する特許請求の範囲第1.項記載 の処理方法。
- 3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は、水に難溶性の物質にシクロデキストリンポリマーを添加混合し、この物質を水溶性のものに変えると共に、その物質的性質及び/又は化学的性質を変化させる処理方法に関するものである。

〔従来の技術〕

一般に各種の医薬品、医薬部外品、化粧品、食品などにはその構成成分としてピタミン類、ホルモン剤、香料、甘味剤などが含まれており、これ

らは通常、水を媒体として他の成分と競拌ないし 鍵合されて上記医変品等を形成するものである。

[発明が解決しようとする問題点]

しかしながら、上記した構成成分では水に難治性のものが多く、このため、これらを均一かつ高速度に配合することにより高品質の製品が得られることが初っていても、配合したのち比較的短期間のうちに他の成分から分離して製品の組成に近が発生し、製品品質が著しく低下して所期の使用目的を充分達成することができない、という問題点があった。

ところで、環状オリゴ糖であるシクロデキスト リンは、その疎水性洞内に種々の物質を包接して、 これらの物質の水溶性、脂溶性、イオン解離定数 など種々の物性を変化させることが古くから知ら れており、シクロデキストリンを用いた種々の物 質の安定化、溶解性の向上などの研究が活発に行 われている。

シクロデキストリンは、現在3種の同族体 (α,

B. τ体)が利用されているが、包接対象が広く 入手が容易なことから f 体が最も多く利用されて おり、β - シクロディストリンを用いた種々の物質の可溶化、安一化については数多く報告されて いる。したし、β - 体は、それ自身の水に対する 溶解度小低いため、その可溶化に対する効果には 限系があり、可溶化したい物質を高速度に可溶化 し、製品に配合することは困難であった。

(問題点を解決するための手段)

本発明者らは、シクロデキストリンを例えばエピクロルヒドリンにより架橋することにより得ることにより得るカクロデキストリンポリマーがシクロデキストリンポリマーがシクロデキストリンポリマーがシクロデキストリンスを含さる。水と任意の部分でなることでは、水と任意のがよって、種々検討冷性のようとの経験的事実に基づいた水に設合するとので、大水に可容性のものに対したない。大水に可容性のものに対したない。大阪では、物質によっては交流のみならず同時に、物質によっては交流のみならず同時に、物質によっては交流を発きに対した場所といいには、シクロデキストリンを開発しているのでは、シクロデキストリンを開発している。

前記シクロデキストリンポリマーは、その水溶性すなわち水に対する溶解度が、25 での水100 ■に対し20 を以上であるものが好ましく、そのためには上記化学式における重合度 n を 3 ~ 4 とすればよく、この値が小さい程シクロデキストリンポリマー自身の水溶性及び前記物質の可溶化効果が高い。

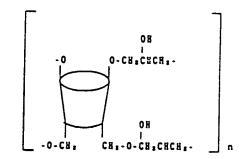
本発明は、水に鍵溶性でシクロデキストリンポリマーと包接化合物を作る物質のすべてに適用できるが、各種の医薬品、香料、色素、端珠剤等への利用が特に有効であり、前記安定化の具体的効果としては、例えば、

- ① 水に不溶性ないし水に難溶性の物質の、水性溶媒中での均一な溶解ないし分散状態の保持 (水性溶媒からの分離の防止)、
- ② 空気中の酸素、熱、太陽光線による物理的 又は化学的変化の助止、
- ② 複数し易い物質の保存性向上 が挙げられる。

本発明を通用した場合に特に有利な結果が得ら

たものが安定なものに変化したり、個数し易い物質が散逸から防止できることを見い出し本発明に 到達したものである。

本発明は、シクロデキストリンポリマー、例えば下記の式



で示される、シクロデキストリンをエピクロルヒドリンにより架構高分子化したシクロデキストリンポリマーを、水に難溶性の物質に添加配合し、これを安定化することを特徴とする物質の処理方法である。

れる対象物質の具体例を列挙すれば、以下のとお りである。

まず、医薬品としては非ステロイド性消炎鎮痛 剤、ステロイド性抗炎症剤、殺菌剤、ビタミン類、 化学療法剤、ホルモン剤などが代表的なものである。

ン、フェノブロフェンカルシウム、ピロキシカムフェアラゾン、フェンチアザク、アセメタシン、ベンダザック、ジメチルイソプロピルアズレン、グリチルレチン酸、,,フェキサマック、フルフェナム酸ブチル、イブプロフェンピコノール、サリチル酸メニル、サリチル酸グリコールなどがあり、

網腎皮質ホルモン剤としては例えば、

ルファピリジン、ナリジクス酸、ピロミド酸、ピ ペミド酸三水和物、エトロフラントイン、シノキ サミンなどがあり、

ホルモン刑としては、例えば、

本発明の方法を効果的に適用できる番料として

段画剤としては、例えば、

クロルヘキシジン、塩酸クロルヘキシジン、塩 化デカリニウム、ヘキサクロロフェン、ピチオノ ール、ニトロフラゾンなどがある。

さらにピタミン蛾としては例えば、

ピタミンA油、エルゴカルシフェロール、ジヒドロタキステロール、アルファカルシドール、ア ロスルチアミン、フルスルチアミン、オクトチア ミン、チアミンジスルフィド、ピスペンチアミン ピスイプチアミン、ペンフェチアミン、シコチア ミン、リボフラピン、踏設リボフラピン、リオフラピン ピリドキサール、葉酸、メコバラミン、ピオチコフ コハク酸トコフェロールカルシウム、酢酸トコフ エロール、ニコチン酸・d f ー α ー トコフェロール、フィトナジオン、メナテトレノンなどがあり、

化学療法剤としては例えば、

スルフィソキサゾール、スルフィソミジン、ス ルファメチゾール、スルファメトキサゾール、ス ルファモノメトキシン、スルファジメトキシン、 スルファフェナゾール、スルファレン、サラゾス

は天然動物香料、天然植物香料、およびこれらから抽出分離或いは他のものから合成した単体香料、及び調合香料がある。

これらのうち天然動物香料としては唇香、霊猫 香、海猫香、竜滋香などがあり、

単体各科については、炭化水素及びその誘導体 としてBromostyroi, Cadinene, Camphene, Cedrene, Diphenylmethane, Dipentene, Limonene, Phellandrene, Pineneが、

Tルコールとしては、Alcohol Co. Alcohol Co. Benzyl alcohol, Borneol, Cedrenol, Cedrol, Citronellol, Cuminic alcohol, α-Cyclogeraniol, β-Cyclogeraniol, Bornesol, Geraniol, Cimethylbenzylcarbinol, Farnesol, Geraniol,

benzoate, Ethyl-butyrate, Ethyl-cinnamate, Ethyl-formate, Ethyl-i-valerianate, Ethyllaurate, Ethyl-myristate, Ethyl-nonylate, Ethyl-octin-carbonate, Ethyl-enanthate. Ethyl-phenylacetate. Ethyl-salicylate. Ethyl-valerianate, Geranyl-acetate, Geranylbenzoate, Geranyl-butyrate, Geranyl-foreate, Geranyl-i-valerianate, Geranyl-propionate, Heptyl-heptoate, Hexyl-formate, i-Amylbutyrate, i-Amyl-caproate, i-Bormyl-acetate, i-Butyl-acetate, i-Butyl-benzoate, i-Butylbutyrate, i-Butyl-phenylacetate, i-Butylsalicylate, Linalyl-acetate, Linalylbutyrate, Linalyl-i-bytyrate, Linalylpropionate, Menthyl-acetate, Menthyl-ivalerianate, Hethyl-anthranilate, Hethylbenzoate, Methyl-butyrate, Methyl-cinnamate. Methyl-heptine-carbonate. Methyl-heptoate. Methyl-hexine-carbonate, Methyl-noninecarbonate, Henthl-octine-carbonate, MethylBydrocinnaeic alcohol, i-Borneol, Lavandulol, Linalool, & -Menthol, Methylphenylcarbinol, Nerol, i-Pulegol, Nerolidol, Phenylethylalcohol, Rhodinol, Santalol, Terpineol が、

エステルとしては、Acetyl-i-eugenol、
Allyl-salicylate、Asyl-acetate、
Asyl-butyrate、Asyl-phenylacetate、
Asyl-nitrate、Asyl-phenylacetate、
Asyl-salicilate、Asyl-valerianate、
Benzyl-sacetate、Benzyl-benzoate、
Benzyl-butyrate、Benzyl-cinnasate、
Benzyl-formate、Benzyl-propionate、
Benzyl-valerianate、Bornyl-acetate、
Butyl-phenylacetate、Cinnasyl-acetate、
Cinnasyl-cinnasate、Citronellyl-acetate、
Citronellyl-formate、Citronellyl-ivalerianate、Cyclohexyl-acetate、
Diethyl-sebacate、Dimethyl-antranilate、Ethyl-acetate、Ethyl-

phenylacetate, Methyl-salicylate, Neryl-acetate, Octyl-acetate, Octyl-butyrate, Phenylethyl-acetate, Phenylethyl-butyrate, Phenylethyl-formate, Phenylethyl-butyrate, Phenylethyl-formate, Phenylethyl-phenylacetate, Phenylethyl-propionate, Phenylethyl-salicylate, Rhodinyl-acetate, Rhodinyl-butyrate, Rhodinyl-formate, Terpinyl-acetate, Terpinyl-butyrate, Terpinyl-formate, Terpinyl-propionate が、アルデヒドとしては、Aldehyde C。, Aldehyde C。,

Aldehyde C. Aldehyde C. ..

Aldehyde C. . (Peach). Aldehyde C. . (Strawberry).

Aldehyde C. .. α-Amyl cinnamic aldehyde.

Anisic aldehyde (Aubepine). Benzaliehyde.

Cinnamic aldehyde. Citral. Citronellal.

Cuminic aldehyde. Ethylvanil!in(Bourbonal).

Heliotropin. Hydrccinnamic aldehyde.

Hydrotropic aldehyde. Hydroxy-citronellal.

Perillaldehyde. Phenylacetaldehyde.

Phenylacetaldehyde-dimethylacetal.

Phenylacetaldehyde-glycerinacetal, Vanilline が、

ケトンとしては、Acetophenone.

o-Rainoacetophenone、Benzophenone。

Benzylideneacetone、Camphor、Carvone。

Civetone、Cyclohexadecanone。

Cyclotetradecanone、Cyclotridecanone。

Ethylamyl ketone(Octanone-3)、Exalton

(Cyclopentadecanone)、Fenchone、α-lonone。

β-lonone、β-lrone、Jassone、β-Henthone。

p-Hethoxy-acetophenone、Hethyl-acetophenone。

Methyl-n-amyl ketone(Heptanone-2)、Hethyl-heptenone、Hethyl-ionone、Hethyl-β
naphthyl ketone(Nerolin)、Hethyl nonyl ketone。

Hethylquinonyl ketone、Huscone、Husk ketone。

Piperitone、Pulegcae、Thujone(Tanacetone) が、

エーテルとしては、Anethole, Cincole(Eucalyptol), p-Cresyloxide, Diphenyloxide, Gerapylaethylether.

ートラジン(黄色 4 号)、ローダミンBステアレート(赤色 2 1 5 号)、テトラクロロフルオレセン(赤色 2 1 8 号)、テトラプロモフルオレセン(赤色 2 2 3 号)、ジブロモフルオレセン(赤色 2 2 3 号)、ジブロモフルオレセン(橙色 2 0 1 号)、キノリンイエローSS(黄色 2 0 4 号)、キニザリングリーンSS(緑色 2 0 2 号)、スカーレットレッド(赤色 5 0 1 号)、スダンブルーB(青色 4 0 3 号)などがある。

また、爆味剤への適用としては、甘味剤への利用が有効であり、特にジヒドロカルコン類への利用が有効である。そして、ジヒドロカルコン、類は例としては、アルニンジヒドロカルコン、ヘスペレチンジヒドロカルコンド、ヘスペレチンジヒドロカルコンラーシャ、ナリンド、ナリンドとよりある。

Isosafrole. Methyl-chavicol(Estrarol).

Hethyl-eugenol, Hethyl-i-eugenol.

Husk ambrette. β-Naphthol butylether.

β-Naphthol ethylether(Rerolin).

β-Naphthol eethylether, Phenyl-pcresyloxide, Phenyl glycolmethyleneether,

Phenyl glycolethyleneether, Safrol.

p-Tolymethylether π's.

フェノールとしては、Amyloxyiso-eugenol, Carvacrol .Eugenol, iso-Eugenol, Thymol が、

ラクトンとしては、Exaltolide, Coumariaが、

敵としては、Benzoic acid, Cinnamic acid, Phenylacetic acid が、

さらに其の他の宣素化合物としては、Indole, Husk xylol, Skatolなどがある。

さらに、本発明を適用できる色素としてはオイルレッド X O (赤色 5 号)、ナフトールイエローS (黄色 1 号)、イエロー O B (黄色 3 号)、タ

(実施例)

実施例 1

(ヘスペリジンジヒドロカルコンモノグリコシド を安定に配合した歯磨剤)

	歯磨用リン説水煮カルシウム	45.0	重量部
•	無水ケイ酸	3.0	•
	カラギーナン	0.2	•
	カルポキシメチルセルロース		
	ナトリウム	0.8	•
A	ソルピット液(60%)	20.0	•
	プロピレングリコール	2.0	•
	ラウリル硫酸ナトリウム	1.5	•
	メチルパラベン	0.15	•
	香料	1.5	•
		20.85	•

ペスペリジンジヒドロカルコン モノグリコシド・シクロデキストリン ポリマー複合体(ペスペリジン ジヒドロカルコンモノグリコシド 5 光w/m 含有) 1.0重量部 特製水 4.0 c

常法に従い強度剤Aを製造した。

β-シクロデキストリンポリマー (3~4 景体)
0.95 重量部を水 4.0重量部にとかし、これに、ヘスペリジンジヒドロカルコンモノグリコシド 0.05 重量部を添加機搾して複合体溶液 Bを製した。

AにBを添加、館合し、ヘスペリジンジヒドロカルコンモノグリコシドを安定に配合した歯磨剤を得た。

実施例 2

(口臭防止用洗口剂)

塩酸クロルヘキシジン・シクロデキストリンポリマー複合体溶液 B を得た。

A. BをCに混合溶解し、口臭防止用洗口剤を得た。

本品は可溶化して配合された香料、塩酸クロル ヘキシジンによる口臭防止効果とシクロデキスト リンによる口臭成分の包接作用により、高い口臭 防止作用が額待できる。

. 実施例 3

(プロスタグランジンB) を安定に配合した歯列矯正用曲肉貼付割)

```
プロスタグランジンB。
シクロデキストリンポリマー複合体
(プロスタグランジンB。
1.6% w/w 含有) 3.0重量部
情襲水 10.0 =
```

-ペパーミント系書料・ シクロデキストリンポリマー迄合体 (香料10%m/m 会有) 15.0重量部 し精製水 15.0 -**F塩酸クロルヘキシジン・** シクロデキストリンポリマー復合体 R (塩酸クロルヘキシジン 2 0 % w/w 含有) 2.0章 景館 L 精型水 5.0 -∟グリモリン 15.0重量部 C|エタノール 30.0 18.0

β - シクロデキストリンポリマー (3 ~ 4 量体) 13.5 重量部を精製水 15.0 重量部にとかし ペパーミント系香料 1.5 重量部を加えて便伴し、ペパーミント系香料・シクロデキストリンポリマー複合体溶液 A を得た。

β-シクロデキストリンポリマー (3~4量体)
1.6重量部を精製水5.0重量部にとかし塩酸
クロルヘキシジン0.4重量部を加えて程線し、

_カルポキシメチルセルロースナトリウム

(1%水溶液の粘度1000cp(20°)) 1.0重量

部ポリピニルアルコール

(重合度500) 2.0 -

ヒドロキシプロピルセルロース

ポリピニルピロリドン(X-30)

(1%水溶液の粘度200cp(20°))10.0 -

ポリエチレングリコール(400) 5.0 -

精製水 64.0 -

世 β - シクロデキストリンポリマー (3~4 置体) 2.952重量部を精製水10.0重量部に とかし、プロスタグランジンE,0.048重量 部を加えて機律し、プロスタグランジンE,・シ クロデキストリンポリマー複合体溶液 A を製する。

Bを混合溶解し、これにAを加え譲合したものを凍結乾燥して製造する。

本品は厚さ 0.5~2 mとしたものを、歯肉に 貼付して歯列場正促進剤として使用される。なお、 本剤の口腔内での貼付時間を長くする目的で片面 に不機布等の支持体又は不溶性フィルムのコーテ ィン「をしても良い。

実施例 4

(ステロイド系抗炎症剤配合外用剤)

	_ヒドロコルチゾン・シクロデキ	ストリン	
A	ポリマー復合体(ヒドロコル	チゾン	
	5 % m/m 含有)	20.0萬量	88
•	L 模型水	20.0	
	_「 エタノ <i>ール</i>	30.0重量	85
В	エタノール 積型水	27.9	
	カーボポール940 ・	1.0	
	しジィップロパノールアミン	1.1	

βーシクロデキストリンポリマー (3~4量体) 19重量部を特製水20重量部にとかし、ヒドロコルチゾン1重量部を加え、機搾してヒドロコルチゾン・シクロデキストリンポリマー複合体溶液 Aを製する。

常法によって製したゲル教育BにAを加え鍵合 して製造する。

実施例 5

(非ステロイド抗炎症剤配合外用剤)

	_ 6	包卜		フ	ı	0	-	ル	•	シ	9		デ	+	ス	F 1	IJ	ン
A	,	ドリ	7	_	復	合	体	(酢	紋	ŀ	J	フ	ı	0	_ ,	レ	
		1 0	ж	w/	w	含	有)							0.	. 21		量部
	一藏日	日村	1	水											2	. 0		•
	+ بر	f 1	磺	놠	ネ	*	ス	チ	1	E	ソ			0	.01	023	Ť	金部
	71	1	ン	欽	2		ル	フ	<u>.</u>	<u>-</u>	ラ	E	ν		0	. 02	2	•
	21	3 5	ブ	9	,	_	ル								0	. 3		•
В	塩(ኒ ^	、ン	#	ル	3	=	ゥ	٨	被	(10	×)	0	. 1		•
	设值	fi #	1												ı	. 0		•
	番	*	ļ												0	. 03	3	•
	L	a #	1 2	水											96	. 34	18	•

β-シクロデキストリンポリマー (3~4量体)
0.18重量部を精製水 2.0重量部にとかし、
酢酸トコフェロール 0.02重量部を加え、潤津
して酢酸トコフェロール・シクロデキストリンポ
リマー複合体溶液 A を製する。

常法により製した目裏BにAを加えて溶解した 後、ミリポアフィルターにより滅菌雄過し目裏を 製造する。

	_インドメタシン・シクロデキス	トリン
	ポリマー複合体(インドメタ	シン
A	1 0 % w/w 含有)	30.0重量部
	- 精製水	20.0
	「エタノール	20.0重量部
	プロピレングリコール	5.0 -
В	カーポポール940	1.0
	ジイソプロパノールアミン	1.1
	_ 精製水	22.9

βーシクロデキストリンポリマー (3~4量体) 27重量部を精製水20重量部にとかし、インド メタシン3重量部を加え機搾して、インドメタシ ン・シクロデキストリンポリマー複合体溶液を製 する。

常法によって製したゲル教育BにAを加え錬合 して製造する。

実施例 6

(ビタミンE配合目薬)

実施例7

(殺菌剤、フケ取り剤を安定に配合した

以至6.70分

 ボソクオマジン・シクロデキストリン

 ポリマー複合体 (デンクオマジン

 1 5 %w/w 含有)
 20.0重量部

 水
 10.0 ~

ーへキサクロロフェン・シクロデキストリン B ポリマー複合体 (ヘキサクロロフェン

1 0 % w/w 含有) 10.0重量部 水 5.0 ~

T ラウリル硫酸ナトリウム 10.0重量部 ヤシ油脂肪酸モノエタノール アマイド 5.0 ~ グリセリンモノステアリン酸 エステル 6.0 ~ 香料 0.5 ~ 色素(Green#3) 0.01 ~

βーシクロデキストリンポリマー (3~4量体)

17 常量部に水10 重量部を加え、さらにデンク オマジン3 重量部を加え提伸するこにより、デン クオマジン・シクロデキストリンポリマー複合体 スラリーAを製する。

β-シクロデキストリンポリマー (3~4量体) 9重量部に水 5重量部を加え、さらにヘキサクロロフェン1重量部を加え 優搾するこにより、ヘキサクロロフェン・シクロデキストリンポリマー複合体のスラリーBを望する。

常法により混合溶解したCにA及びBを加え、均一とし頭壁洗浄剤を製造する。

実施例8

(色素、香料を安定に配合した浴剤)

部を水40重量部に溶かし、A及びBを添加した 溶液を硫酸ナトリウム45部とポリリン酸ナトリ ウム45部の混合物に加え、複合した後、押し出 し造粒機により、顆粒状とし、顆粒状の浴剤を製 造する。

また、A及びBを凍結乾燥し複合体粉末とした 後、硫酸ナトリウムとポリリン酸ナトリウムと混 合し、常法により、乾式追拉により顆粒状の浴剤 を製造する。

<u>実施例 9</u>

(香料を安定に配合した液状洗浄剤)

B ポリマー複合体 (ジャスミン系香料 8 % w/w 含有) 5.0 重量部 次 5.0 重量部 は 45.0 重量部 は 1 が 45.0 で な 1 が 45.0 で カルボキシメチルセルロース ナトリウム 3.0 で 水 40.0 で

8-シクロデキストリンポリマー(3~4量体) 4.55重量部を水5.0重量部にとかし、フル オレセイン0.45重量部を加え、優搾し、フル オレセイン・シクロデキストリンポリマー複合体 溶液人を製する。

8-シクロデキストリンポリマー (3~4量体)
4.6重量部を水5.0重量部にとかし、ジャスミン系各料0.4重量部を加え、機拌し、各料・シクロデキストリンポリマー複合体溶液Bを製する。

カルボキシメチルセルロースナトリウム3重量

アルキルエーテルサルフェート 20.0重量部 ドパノール・エチレンオキサイド

付加物 (12~15モル付加) 12.0 ~ B トルエンスルホン酸ナトリウム 5.0 ~ エチルアルコール 4.0 ~ ポリエチレングリコール(1000) 1.5 ~ 水 42.5 ~

β-シクロデキストリンポリマー (3~4量体) 4.5重量部を水10.0重量部にとかし、レモン系香料0.5重量部を加え、履粋し、資料・シクロデキストリンポリマー複合体溶液Αを製する。

Bを各々混合溶解したものにAを加えて各料を 安定に配合した液状洗浄剤を製造する。

<u>実施例10</u>

(設閣剤、香料を安定配合し、かつ、それらを持 統放出する制汗剤)

_へキサクロロフェン 0.1重量部 В β-シクロデキストリンポリマー 0.9 × 5.0 -ーリハイドロールASC 7.0重量部 ミリスチン酸イソプロピル 1.5 -ポリオキシエチレンアルキルリン C 敵エステル 1.0 -トリメチロールプロパン 2.0 -無水エタノール 34.5 フロン12 30.0 -しフロン114 20.0

水10重量部に8-シクロデキストリンポリマー(4~6量体)とフローラル系香料を加え機神し、フローラル系香料・シクロデキストリンポリマー複合体溶液Aを得る。これを凍結乾燥して、フローラル系香料・シクロデキストリンポリマー複合体粉末を製する。

水 5 重量部に 8 - シクロデキストリンポリマー (4 ~ 6 量体) とヘキサクロロフェン 0 . 1 重量 部を加え促拌し、ヘキサクロロフェン・シクロデ

・シクコデキストリンポリマー複合体溶液Aを得る。これを複結乾燥し、複合体の粉末を製する。

水10重量部にフローラル系香料 0.5重量部、 β-シクロデキストリンポリマー (4~6量体) 4.5重量部を加え復搾し、フローラル系香料・ シクロデキストリンポリマー複合体溶液 Bを得る。 これを凍結乾燥し、複合体の粉末を製する。

Cの組成物を60でに加温し、重合したもの94重量部に、Aの粉末1.0重量部、Bの粉末5.0重量部を加え200円では合し、香料、200円を配合した衛生材料品用の高分子吸収剤を製造する。

本品を生理用品等に配合することにより防臭効果、 段図効果が持続するとともに、 シクロデキストリンのもつ包接作用で臭い物質を包接することにより、高い消臭効果が期待できる。

キストリンポリマー複合体溶液Bを得る。これを 複結乾燥して、ヘキサクロロフェン・シクロデキ ストリンポリマー複合体粉末を型する。

A及びBの粉末をCと混合し、常法に従ってスプレー式の割汗剤を製造する。

実施例11

(収画、防臭効果を持続させた衛生材料品)

水 5 重量部にヘキサクロロフェン 0 . 1 重量部、 β - シクロデキストリンポリマー (4 ~ 6 量体) 0 . 9 重量部を加え健拌し、ヘキサクロロフェン

実施例12

(油溶性ピタミン配合栄養ドリンク剤)

	「ピタミンA油	0.01重量部
	菜数	0.005 -
	酢酸トコフェロール エルゴカンフェロール β- シクロデキストリンポリマ	0.02 -
Α	エルゴカシフェロール	0.001 -
	β - シクロデキストリンポリマ	-
	(3~4量体)	2.0
	- 韓製水	5.0 -

	ドタウリン	2.0 重量節
	L-アルギニン塩放設	0.3
	イノシトール	0.1
	パンテノール	0.02
	ピタミンB:硝酸塩	0.01 -
	ピタミン8:リン酸塩	0.005 -
	ピタミン8.	0.005 -
В	ニコチン酸アミド	0.02 -
	クエン設	0.3
	リンゴ酸	0.08 -
	カフェイン	0.04 -
	ニンジン抽出液	0.2
	ハチミツ	3.0
	烤味剂	0.2
	上 精製水	86.684 -

B-シクロデキストリンポリマー(4~6量体)
2. 0部を精製水5. 0部にとかし処方量のピタミンA油、柔酸、酢酸トコフェロール、エルゴカシフェロールを加え、荒拌することにより複合体溶液を製する。

手統補正書(抗)

昭和60年2月19日

特許庁長官 志 質 学 図

- 1. 事件の表示 昭和59年 特許職 第217332号
- 2. 発明の名称 物質の処理方法
- 3. 補正をする者

事件との関係 特許出職人

名 称 (676) ラ イ オ ン 株式会社

4. 代理人

居 所 〒105 東京都港区虎ノ門1丁目4番4号 川村ビル4階 電話(508)0593(代)

氏 名 (7391) 弁理士 高 木 正



5. 補正命令の日付 昭和60年1月29日(発送日)

6. 補正の対象 明細雲の発明の詳細な説明の概

7. 補正の内容 別紙の通り

方式 第五

各成分を混合溶解したBにAを加えて溶かし、 ドリンク剤を製造する。

(発明の効果)

本発明方法は、エピクロルヒドリンにより混構高分子化されたシクロデキストリンポリマーを引 か水に観溶性の物質を可溶化し、安定配合シクラを は ない では ターシック ロデキストリンによる可溶化では ターシック ロデキストリンの水に対する溶解度が低いたが、 本発明の 切質の可溶化しかできなかったが、 本発明のシクロデキストリンポリマーを用いることにより多量の物質を可溶化し、製品に配合する ことが可能となった。

そして本発明は医薬品、医薬部外品、化粧品、 食品、家庭雑貨品、染料、写真材料、展菓等への 応用が可能であって、これらの物質を上記した意 味において安定化することができ、したがって本 発明により、従来品に比べ種々の面で高品位、高 品質の医薬品等々を、簡単なプロセスで生産でき るという類響な効果が得られるものである。

粉越昭59-217332

14 正 書

本租明福書中

1. 第11頁第12行から第16頁第17行を、 たのとおりに打正する。

「としてプロモスチロール(Bromostyrel)、カディネン(Cadimene)、カンフェン(Camphene)、セデレン(Cedrene)、ジフェニルメタン (Diphenylaethase)、ジベンテン(Dipentane) リモネン(Lieomene)、フェルランドレン (Phellandrene)、ビネン(Pinene)が、

アルコールとしては、ベンジルアルコール
(Benzyl alcohol) 、ポルネオール (Borneol)。
セデレノール (Cedresol)。セデロール (Cedrol) 。
シトロネロール (Citronellol)。 クミニックアル
コール (Ceninic alcohol)。 ローンクロゲラニオール (G. Cyclogeraniol) 、 カーシクロゲラニオール (B. Cyclogeraniol) 、 ジメチルベンジルカルビノール (Dimethylbenzylcarbinol) 、ファー

ネゾール (Farmezol) 、ゲラニオール (Gereatel) 、 ヒドロシンナミック アルコール (Mydrocinsanic sicobel), iーポルネオール (i-Berasol). ラベンダロール (Lavaedsiol) . リナロール (Linelcol) , &- / ントール (&-Reathol) . メチルフェニルカーピノール(Rethylpheaylcarbisol.) ユロール (Merel)、iーアレゴール (i-Palegol)。 ユロリドール(Herolidol)、フェニルエチルア ルコール (Phenylethylalcohol) . フェディノー ル (Phodisol) , サンタロール (Sastalol) . タ ーピネオール(Terpiseol)が、 エステルとしては、アセチル・i-オイゲノー ル (Acetyl-1-eugenol) 、アリルサリテレート (Allyl-salicylate) . 節盤アミル (Asyl-acetate). アミルプチレート(Appl-belyrate)。 アミルヘア・ チネカルポキシレ・ト(Asylbeptiascarboxylate). 研設アミル(Anyl-aitrate)、アミルフェニルアセ テート(Asyl-pheaylacetate)、サリチル設アミル (Asyl-salicilate), 古草放了ミル(Asyl-valerianate). 部盤ペンジル(Beasyl-acetate)、ペンジルペンゾ

エード(Beaty)·beatoats), 盆放ベンジル(Beaty)・ batyrate)。 ベンジルシンナメート(Bensylclassaste). ギ酸ペンジル(Bessyl-(orests). プロピオン数ペンジル(Bessylvarosiesate)。 吉卓酸ペンジル(Beatyl·valorianale)。 プロニル アセテート(Borayl-acetate)、ブチルフュニルア セテート(Butyl-phonylacetate), シンナミルアセ テート(Cianosyl-acotate)、シンナミルシンナメ ート (Cienasyl-ciaeaeate) 、シトコネリルアセ テート(Citroselly)-acetate),シトロネリルフェ ーメート (Citroselly)-foreste)、シトロネリル - i - パレリネート (Citroselly1-i-valeriseate). シクロヘチシルアセテート(Cyclobezyl-acetate), ジアセチル(Diacetyl)、ジエチルセパケート (Diethyl-sebacate)。ジメチルアントラニレート (Dioothyl-antractiate)、 砂粒エチル(Ethylacetate), エチルアントラニレート(Ethylastracilate), エチルペンゾエート(Ethylbeazoate) 、自位プテル(Ethyl-betyrate)、エナ ルシンナメート(Ethyl-ciananate), ギロエチル

(Ethyl-formate)、i-吉草位エチル (Ethyl-ivaloriagate)。ラウリン放エチル(Ethyl-laorate)。 ミリスチン粒エチル(Ethyl·oyristate),エチルノ ニレート(Ethyl-monylate)、エテルオクチンカー ポネート(Ethyl-octia-carbonate),エテルエナテ ート(Ethyl-essathata).エチルフェニルラクテー ト(Ethyl-phenylacetate),サリテル酸エテル (Ethyl-salicylate)、言草数エテル(Ethylvalarianata), ゲラニルフセテート(Garanyl. acetate)、ゲラニルベンゾエート(Gerasylbeazonte),ゲラニルプナレート(Geranyl-butyrate). ゲラニルフォーメート(Geraevi-Jorgate)、ゲラニ ルートーパレリネート(Geranyl-i-valorisants). ゲラニルプロピオネート(Geraayl-propiosate)。 ヘプチルヘプテート(Beptyl-beptoate), ヘキシル フェーメート(Hexyl-foreste), iーアミルプチレ ート(i-Amyl-butyrate), iーアミルカプロエート (i-Apyl-caproate), iープロニルアセテート(i・ Borayl-acetate). i ープチルアセテート(i-8qtylacetate), iープチルベンゾエート(1-8utyl-

beszoate), I-プテルプチレート(i-Eutyibetyrate), iープチルフェニルアセテート(i. Butyl-pheaylacetate)、iープチルサリチレート (i-Betyl-salicylate)、リナリルアセテート (Liealyl-acetate), リナリルプチレート(Liealylbetgrate),リナリルートープチレート(Lisaly). i-bytyrate)。リナリルプロピオネート(Linely)propiosate),メンチルアセテート(Heathyl-acetate). メチルートーパレリネート(Reathyl-i-valgrissate). メチルアントラニレート(Methyl-anthronilate)、 メチルベンゾエート(Retayl-beszonte)。メチルブ チレート(Hethyl-betyrate),メチルシンナメート (Rethyl-cianamate)、メチルヘプチンカーポネー ト(Hethyl-heptime-carbonate)、メチルヘプテー ト(Rethyl-heptoate),メチルヘキシンカーポネー ト(fiethyl-bezies-carbonate)。イチルノニネカー ポネート(Helbyl-sosise-carbonate),メチルオク チンカーポネート(Reath)・octine-carbonate)。メ チルフェニルアセテート(Methyl-pheaylacetate), サリチル放メチル(Sathvi-salicylate), ネリルフ

セテート(Moryl-acetate),オクテルアセテート (Octyl-scetate)、オクチルプチレート(Octylbutyrate),フェナシルプチレート(fhemacyl・ betyrate),フェニルエチルアセテート(Phenylethylacetate)、フェニルエチルプテレート(Pheaplethy)butyrate).フェニルエチルフォーメート (Pheaplethyl·foreste),フェニルエチルフェニル アセテート(Phoeylethyl-phonylacetate),フェニ ルエチルプロピオネート(Phenylethyl·propionate), フュニルエチルサリチレート(Phenylethylsalicylate).ローディニルアセテート(Rhodieylacetate)、ローディニルプチレート(faodisylbutyrate),ローディニルフォーメート (Ebodisyl-(oreste)、 ターピニルアセテート(Terpieylacetate)、ターピニルプチレート(Terplay)・ butyrate), ターピニルフェーメート(Terpley)-(oreate)。 ターピニルプロピオネート(Terplay)propionate) が、

アルデヒドとしては、αーアミルシンナミック アルデヒド (α-Aayl cinsasic aldebyde).

アニシックアルデヒド(Aminic aldebyde) (Aubopine)、ベンズアルデヒド(Benzaldehyde)。 シンナミックアルデヒド(Classaic aldebyde).シ トラール(Citral)、シトロネラール(Citrosellal)。 クミックアルデヒド(Cominic aldohyde)、エチル パニリン(Ethyivasillis) (Bourbousi)、ヘリオト ロピン(Selletrepia),ハイドロシンナミックアル アヒド(Erdrecianagic aldebyda)、ハイドロトロ ピックアルテヒド(Bydrotropic aldebyde). ヒド ロキシシトロネラール(Eydrozy-citrocellai).べ リルアルデヒド(Parilialdehyde)。フェニルアセ トアルデヒド(Pheerlacetaldehyde)、フェニルア セトアルデヒドージメチルアセクール (Phenylacetaldehyde-dinethylacetal), 7 = = N アセトアルデヒドーグリセリナセタール (Pheaylacetaldebyde-glycerisacetal), バニリン (Vacillies) が、

ケトンとしては、アセトフェノン(Acetophesone)。
o ーアミノアセトフェノン(o-Aeleoacetophesone)。
ベンゾフェノン(Aesgophesone)。ベンジリデンア

セトン(Benzylideneacetone)。カンファー (Camphor),カルポン(Carvone),チベトン(Civetone). シクロヘキサデカノン(Cyclobezadecasone).シク ロテトゥデカノン(Cyclotetradecasose)、シクロ トリデカノン(Cyclotridecanone)。エチルアミル ケトン(Ethylanyl betone)(Octasone-3). シクロ ペンタデカノン(Cyclopentadecamone)。フェンコ ν (Fenchose), $\alpha - 4 \pm 1 \nu$ (α -locose), $\beta -$ イオノン (B-logome), B-イロン (B-irome). ジャスモネ(Jazeose), &ーメントン(&-Mesthose), pーメトキシーアセトフェノン(p-Rethoxy・ acetophenome),メチルアセトフェノン(Methylscetophesone).メチルーローアミルケトン(Methyla-seyl ketose)(Meptasoce-2).メチルヘアタノン (Rethyl-heptesons), メチルイオノン(Rethylioacee).メチルーターナフチルケトン(Rethyl-8. caphthyl ketome)(Rerolim).メチルノニルケトン (Methyl coeyl ketone), メチルキノリルケトン (Rethylonisomyl betone), ムスコン(Ruscone), ム スクケトン(Rusk betoes),ピペリトン(Piperitone),

プレゴン(Pelegose)、ツヨン(?trjone)(Tanacetone)が、

エーテルとしては、アネトール(Amelbole). シネオール(Clasole)(Eucalyptol)、pークリザロ キサイド(p-Cresploside), ジフェニルオチサイド (Dicheavloxide), ゲラニルメチルエーテル (Geraeylaethylether), イソサフロール (Isosafrole)、メチルチャピコール(Retbylchavical)(Estragol),メチルオイゲノール (Hethyl-suggeol)、メチル・ミーオイケノール (Rethyl-1-eugesol)、ムスクァンプレット (Resk ambrette)。 βーナントールプチルエーテ ル (B-Haphthol butylether). B・ナフトールエ チルエーテル (B.Haphthol ethylether)(Merolis), B-+フトールメチルエーテル (B·Haphtho) sethylether),フェニルータークリザロキサイド (Pheeyl-p-cresylozide)、フェニルグリコールメ チレンエーテル(Phenyl glycologthylessether), フュニルグリコールエチレンエーテル(Phenyl glycglethylesesther). サフロール(Safrol).

p ートリメチルエーテル(p-Tolysothylother) が、 フェノールとしては、アミロキシイソオイデノ ール(Asyloxylso-esgenol)。カルパコール (Carvacrol)。オイゲノール(Esgenol)。イソオイゲ ノール(Iso-Esgenol)。チモール(Thynol)が、 ラクトンとしては、エキザリトリド(Exaltolide)。 クマリン(Counaria)が、 被としては、安息香酸(Beasolc acid)。 後京級

載としては、安息書献(Bessolc acid)、在反数(Cissesic acid)、フェニルアセティックアシド
(Phesylacetic acid) が、

~ さらに其の他の窒素化合物としては、インドール(ladole)、ムスクキシロール(Resk zylol)、スカトール(Statol)などがある。J

- 第21頁第10行の「P.E.G.」を、「ポリエチ レングリコール」と訂正する。
- 3. 第26頁第18行の「Gasa83」を、「青色3号」 と訂正する。

REF